

51

Int. Cl. 2:

C 07 C 103-46

19 BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

C 07 C 103-66

C 07 C 103-737



C 07 C 103-52

A 01 N 5-00

A 01 N 9-20

DT 25 15 113 A1

11

# Offenlegungsschrift 25 15 113

21

Aktenzeichen:

P 25 15 113.7

22

Anmeldetag:

7. 4. 75

43

Offenlegungstag:

23. 10. 75

30

Unionspriorität:

32 33 31

9. 4. 74 Schweiz 4998-74

7. 3. 75 Schweiz 2906-75

54

Bezeichnung:

Mikrobizide und wachstumsregulierende Mittel

71

Anmelder:

CIBA-GEIGY AG, Basel (Schweiz)

74

Vertreter:

Zumstein sen., F., Dr.; Assmann, E., Dipl.-Chem. Dr.rer.nat.;  
Koenigsberger, R., Dipl.-Chem. Dr.; Holzbauer, R., Dipl.-Phys.;  
Zumstein jun., F., Dipl.-Chem. Dr.rer.nat.; Pat.-Anwälte, 8000 München

72

Erfinder:

Hubele, Adolf, Dr., Magden (Schweiz)

DT 25 15 113 A1

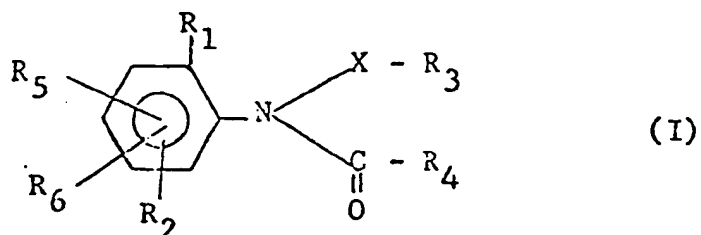
5-936C/1+2/=

Deutschland

Dr. F. Zürnstein sen. - Dr. E. Assmann  
 Dr. R. Koch - Dr. G. F. H. Holzbauer  
 Dr. G. F. H. Holzbauer - Dr. Zürnstein jun.  
 Patentanwälte  
 8 München 2, Bräuhausstraße 4

Mikrobizide und wachstumsregulierende Mittel

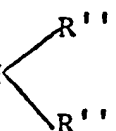
Die vorliegende Erfindung betrifft Verbindungen der  
 Formel I



worin

- $R_1$   $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder Halogen,  
 $R_2$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_3$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder Halogen,  
 $R_5$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_3$ -Alkyl oder Halogen  
 $R_6$  Wasserstoff oder Methyl sind, wobei die Gesamtzahl  
 von C-Atomen der Substituenten  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_5$  und  $R_6$   
 im Phenylring die Zahl 8 nicht übersteigt,

X  $-CH_2-$  oder  $-CH(\overset{CH_3}{})-$ ,

$R_3$   $-COOR'$  oder  $-CON$   darstellen, wobei

$R'$ ,  $R''$  und  $R'''$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  
 Methyl oder Äthyl bedeuten und

509843/0963

$R_4$  ein gegebenenfalls durch Cyano (-CN) oder Rhodano (-SCN) substituiertes  $C_1-C_6$ -Alkyl,  $C_2-C_5$ -Alkenyl oder  $C_3-C_7$ -Cycloalkyl bedeuten.

ein Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen sowie Mittel, die diese Verbindungen als Wirkstoffe enthalten, und die Verwendung dieser Wirkstoffe als Mikrobizide und als pflanzenwachstumsregulierende Mittel.

Unter Alkyl und als Alkyl-Teil einer Alkoxy-Gruppe sind je nach Zahl der angegebenen Kohlenstoffatome folgende Gruppen zu verstehen: Methyl, Aethyl, n-Propyl, iso-Propyl oder n-, iso-, sec- oder tert-Butyl sowie die Pentyl- oder Hexyl-Isomeren. Als Alkenylreste sollen z.B. Vinyl, Allyl, Methylallyl, Butenyl, Methylbutenyl und ihre Isomeren verstanden werden, während die Cycloalkylreste Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl und Cycloheptyl umfassen. Als Halogen kommen Fluor, Chlor, Brom oder Jod in Frage.

In der Deutschen Offenlegungsschrift Nr. 2'212'268 wird in allgemeiner Form angegeben, dass N-haloacylierte Anilino-alkancarbonsäureester selektive herbizide Wirkung besitzen. Es werden jedoch nur einige N-haloacetylierte 2,6-Di-alkylanilino-essigsäuren und ihre Ester namentlich genannt und als Herbizide belegt. Hinweise auf mikrobizide, insbesondere pflanzenfungizide Wirkung werden nicht gegeben.

Es wurde nun überraschend gefunden, dass Verbindungen mit der deutlich abweichenden Struktur der Formel I ein für die praktischen Bedürfnisse sehr günstiges Mikrobizid-Spektrum zum Schutze von Kulturpflanzen aufweisen. Kulturpflanzen seien im Rahmen vorliegender Erfindung beispielsweise Getreide, Mais, Reis, Gemüse, Zuckerrüben, Soja, Erdnüsse, Obstbäume, Zierpflanzen, vor allem aber Reben, Hopfen, Gurkengewächse (Gurken, Kürbis,

509843/0963

Melonen), Solanaceen wie Kartoffeln, Tabak und Tomaten, sowie auch Bananen-, Kakao- und Naturkautschuk-Gewächse.

Mit den Wirkstoffen der Formel I können an Pflanzen oder Pflanzenteilen (Früchte, Blüten, Laubwerk, Stengel, Knollen, Wurzeln) dieser und verwandter Nutzkulturen die auftretenden Pilze eingedämmt oder vernichtet werden, wobei auch später zuwachsende Pflanzenteile von derartigen Pilzen verschont bleiben. Die Wirkstoffe sind gegen die den folgenden Klassen angehörenden phytopathogenen Pilze wirksam: Ascomycetes (z.B. Erysiphaceae); Basidiomycetes wie vor allem Rostpilze; Fungi imperfecti (z.B. Moniliales); dann aber besonders gegen die der Klasse der Phycomycetes angehörenden Oomycetes wie Phytophthora, Peronospora, Pseudoperonospora, Pythium oder Plasmodiopsis. Ueberdies wirken die Verbindungen der Formel I systemisch. Sie können ferner als Beizmittel zur Behandlung von Saatgut (Früchte, Knollen, Körner) und Pflanzenstecklingen zum Schutz vor Pilzinfektionen sowie gegen im Erdboden auftretende phytopathogene Pilze eingesetzt werden.

Bevorzugt als Mikrobizide sind Verbindungen der Formel I, bei denen  $R_1$  Methyl bedeutet,  $R_2$  in ortho-Position zur Aminogruppe steht und Methyl, Aethyl oder Chlor bedeutet,  $-X-R_3$  die Gruppierung  $\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ | \\ -\text{CH}-\text{COOR}' \end{array}$  besitzt, während  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_6$  und  $R'$  die

angegebene Bedeutung haben. Diese sollen Verbindungsgruppe Ia genannt werden.

Unter diesen Verbindungen der Gruppe Ia sind solche auf Grund ihrer Wirkung hervorzuheben, bei denen  $R'$  Methyl bedeutet,  $R_4$  für einen Alkyl-, Alkenyl- oder Cycloalkylrest mit 2 - 4 C-Atomen steht und  $R_5$  und  $R_6$  die angegebene Bedeutung haben, wobei die Gesamtzahl von C-Atomen der Substituenten  $R_1, R_2, R_5$  und  $R_6$  im Phenylring die Zahl 4 nicht übersteigt.

509843/0963

2515113

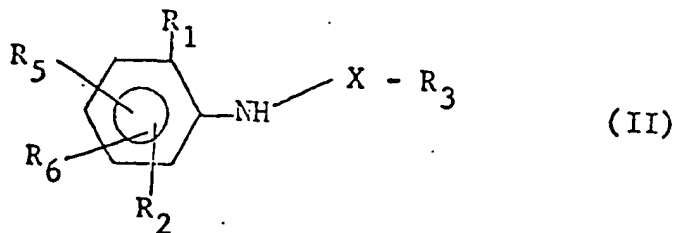
Eine andere wichtige Untergruppe von Verbindungen sind diejenigen der Formel I, worin  $R_2$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_3$ -Alkyl oder Halogen und die Substituenten  $R_5$  und  $R_6$  Wasserstoff bedeuten, während die Substituenten  $R_1, R_3, R_4, X, R', R''$  und  $R'''$  die für Formel I gegebene Bedeutung haben.

Auf speziellen Einsatzgebieten, z.B. als Beizmittel oder gegen Bodenpilze, sind ferner solche Verbindungen der Formel I oder der Untergruppe Ia sehr vorteilhaft, bei denen  $R_4$  eine Cyanomethyl- oder Rhodanomethyl-Gruppe bedeutet.

Eine weitere, zur Pflanzenregulation bevorzugte Verbindungsgruppe sind solche der Formel I, bei denen  $R_1$  Methyl oder Aethyl bedeutet,  $R_2$  in ortho-Position zur Aminogruppe steht und Methyl, Aethyl oder Chlor bedeutet,  $-X-R_3$  die Gruppierung  $-CH_2-CO-N(R'')(R''')$  darstellt, während  $R_4, R_5, R_6, R''$  und  $R'''$  die angegebene Bedeutung haben.

Unter Pflanzenregulation soll in erster Linie die retardierende Steuerung der natürlichen Pflanzenentwicklung verstanden werden, vornehmlich die wünschenswerte Reduktion der Pflanzengrösse, insbesondere der Wuchshöhe. Diese Wuchsreduktion wird an mono- und dicotylen Pflanzen, insbesondere an Gräsern, Getreidekulturen, Soja und Zierpflanzen beobachtet.

Die Herstellung der Verbindungen der Formel I erfolgt erfindungsgemäss beispielsweise durch Acylierung einer Verbindung der Formel II



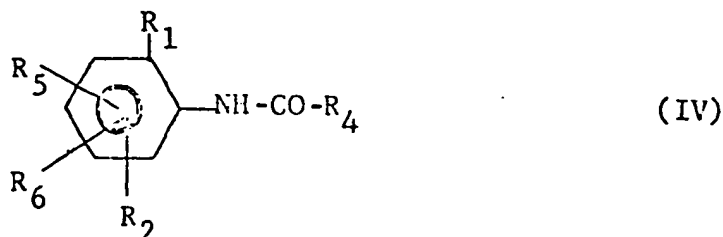
mit einer Carbonsäure der Formel III



oder ihrem Säurehalogenid, Säureanhydrid oder Ester, in Einzelfällen auch mit einem ihrer Säureamide (Umamidierung).

509843/0963

Nach einer anderen erfindungsgemässen Methode können die Verbindungen der Formel I auch aus den Acylaniliden der Formel IV



mit Butyl-Lithium oder Na-Hydrid in das entsprechende Alkalisalz überführt werden, welches dann mit einer Verbindung der Formel V



zum gewünschten Endprodukt führt, oder aus den Acylaniliden der Formel IV mit der Verbindung der Formel V in Gegenwart eines Alkalicarbonats (wie  $\text{Na}_2\text{CO}_3$  oder  $\text{K}_2\text{CO}_3$ ) als Protonenakzeptor, vorzugsweise unter Zusatz katalytischer Mengen Alkalijod (wie KJ) hergestellt werden.

In den Formeln II, III, IV und V haben  $\text{R}_1$  bis  $\text{R}_6$  und X die für Formel I angegebene Bedeutung, während "Hal" für ein Halogenatom, vorzugsweise Chlor oder Brom, oder einen anderen leicht abspaltbaren Rest steht. Der Begriff "Säurehalogenid" steht vorzugsweise für das Säurechlorid oder Säurebromid.

Die Umsetzungen können in An- oder Abwesenheit von gegenüber den Reaktionsteilnehmern inerten Lösungs- oder Verdünnungsmitteln durchgeführt werden. Es kommen beispielsweise folgende in Frage: aliphatische oder aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, Xylole, Petroläther; halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol, Methylenchlorid, Äthylenchlorid, Chloroform; Äther und ätherartige Verbindungen wie Dialkyläther, Dioxan, Tetrahydrofuran; Nitrile wie Acetonitril; N,N-dialkylierte Amide wie Dimethylformamid; wasserfreie Essigsäure, Dimethylsulfoxid, Ketone wie Methyläthylketon und Gemische solcher Lösungsmittel untereinander.

Die Reaktionstemperaturen liegen zwischen  $0^{\circ}$  und  $180^{\circ}$  C, vorzugsweise zwischen  $20^{\circ}$  und  $120^{\circ}$ . In manchen Fällen ist die Verwendung von säurebindenden Mitteln bzw. Kondensationsmitteln vorteilhaft. Als solche kommen tertiäre Amine wie Trialkylamine (z.B. Triäthylamin), Pyridin und Pyridinbasen, oder anorganische Basen, wie die Oxide und Hydroxide, Hydrogencarbonate und Carbonate von Alkali- und Erdalkalimetallen sowie Natriumacetat in Betracht. Als säurebindendes Mittel kann ausserdem beim ersten Verfahren ein Ueberschuss des jeweiligen Anilinderivates der Formel II dienen.

Das von Verbindungen der Formel II ausgehende Herstellungsverfahren kann auch ohne säurebindende Mittel durchgeführt werden, wobei in einigen Fällen das Durchleiten von Stickstoff zur Vertreibung des gebildeten Halogenwasserstoffs angezeigt ist. In anderen Fällen ist ein Zusatz von Dimethylformamid als Reaktionskatalysator sehr vorteilhaft.

Einzelheiten zur Herstellung der Zwischenprodukte der Formel II kann man den Methoden entnehmen, wie sie allgemein für die Herstellung von Anilino-alkansäureestern in folgenden Publikationsorganen angegeben werden:

J.Org. Chem. 30, 4101 (1965),  
Tetrahedron 1967, 487,  
Tetrahedron 1967, 493,

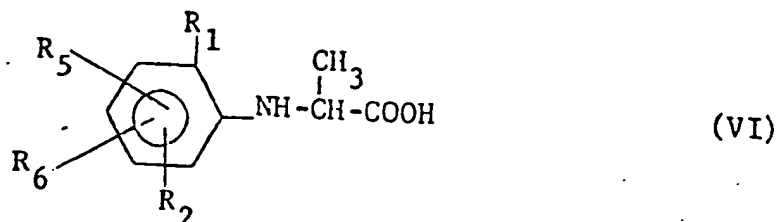
Die Verbindungen der Formel I mit der Bedeutung  $X = \begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ | \\ -\text{*CH}- \end{array}$  besitzen ein asymmetrisches Kohlenstoffatom (\*) und können auf übliche Art in optische Antipoden gespalten werden. Hierbei besitzt die enantiomere D-Form die stärkere mikrobizide Wirkung.

Im Rahmen der Erfindung sind demgemäss diejenigen Verbindungen, ihre Mittel und ihre Verwendung bevorzugt, welche sich auf die D-Konfigurationen der Formel I beziehen. Diese D-Formen besitzen bei der Messung in Aethanol oder Aceton in der Regel einen negativen Drehungswinkel.

509843/0963

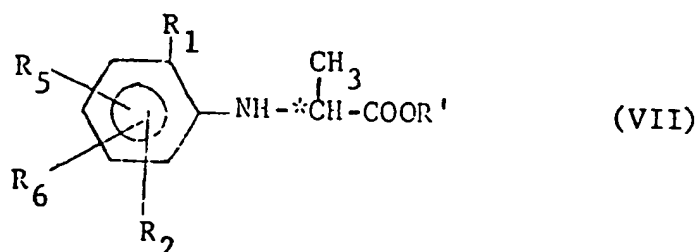
2515113

Zur Herstellung der reinen optischen D-Antipoden wird z.B. die racemische Verbindung der Formel VI



worin  $R_1, R_2, R_5$  und  $R_6$  die für Formel I genannte Bedeutung haben, hergestellt und dann in an sich bekannter Weise mit einer N-haltigen optisch aktiven Base zum entsprechenden Salz umgesetzt. Durch fraktionierte Kristallisation des Salzes und nachfolgende Freisetzung der mit dem optischen D-Antipoden angereicherten Säure der Formel VI und gegebenenfalls Wiederholung (auch mehrfache Wiederholung) der Salzbildung, Kristallisation und Freisetzung der  $\alpha$ -Anilinopropionsäure der Formel VI gewinnt man stufenweise die reine D-Form. Aus dieser lässt sich dann, soweit erwünscht, auf übliche Art, z.B. in Gegenwart von HCl oder  $H_2SO_4$ , mit Methanol oder Aethanol die optische D-Konfiguration des der Formel II zugrundeliegenden Esters herstellen, oder mit dem entsprechenden Amin der Formel  $HN(R'')(R''')$  das der Formel II entsprechende Amid, vorzugsweise über das Säurehalogenid, herstellen. Als optisch aktive organische Base kommt z.B.  $\alpha$ -Phenyläthylamin in Frage.

Anstelle der fraktionierten Kristallisation lässt sich die enantiomere D-Form der Formel VII

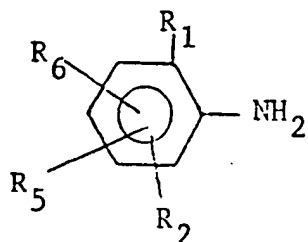


auch darstellen, wenn man die Aminogruppe im natürlich vorkommenden L-Alanin in Gegenwart von z.B. HCl oder HBr diazotiert und damit unter  $N_2$ -Abspaltung und unter Retention der L-Konfiguration gegen Halogen austauscht, danach gegebenenfalls

509843/0963



mit Methanol oder Aethanol verestert und dann mit dem Anilin der Formel VIII



(VIII)

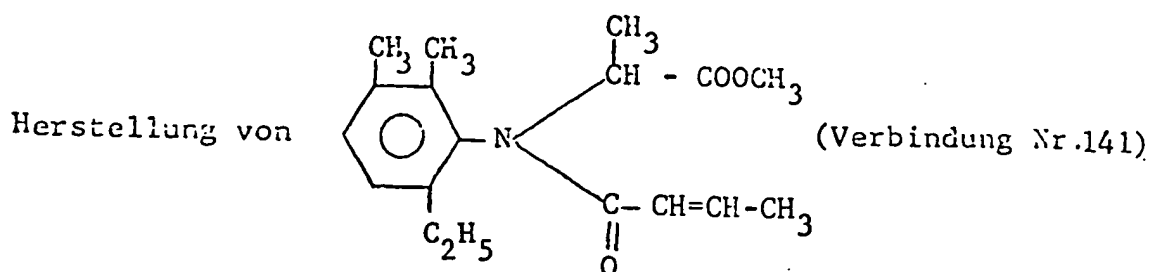
umsetzt, wobei überwiegend Inversion zu den D-Konfigurationen der Formel VII eintritt (J.Am.Chem. Soc. 76,6056). Sinngemäß lassen sich auch die Amide mit  $R_3 = \text{CON}(R'')(R''')$  auf diese Art darstellen. Unabhängig von der genannten optischen Isomerie wird in der Regel eine Atropisomerie um die Phenyl—N < Achse in den Fällen beobachtet, wo der Phenylring mindestens in 2,6-Stellung und gleichzeitig unsymmetrisch zu dieser Achse (gegebenenfalls also auch durch die Anwesenheit zusätzlicher Substituenten) substituiert ist. Diese Erscheinung ist bedingt durch die sterische Hinderung der zusätzlich am N-Atom eingeführten Reste  $-X-R_3$  und  $-\text{CO}-R_4$ .

Unabhängig von der genannten optischen Isomerie kann ferner im Falle  $R_4 = \text{Alkenyl}$  eine cis/trans-Isomerie an der Doppelbindung auftreten.

Sofern keine gezielte Synthese zur Isolierung reiner Isomere durchgeführt wird, fällt normalerweise ein Produkt als Gemisch zweier optischer Isomere, zweier Atropisomere, zweier cis, trans-Isomere oder als Gemisch dieser möglichen Isomere an. Die grundsätzlich günstigere fungizide Wirkung der enantiomeren D-Form (im Vergleich zur D,L-Form oder zur L-Form) bleibt jedoch erhalten und wird nicht nennenswert durch die Atropisomerie oder die cis/trans-Isomerie beeinflusst.

Die nachfolgenden Beispiele dienen zur näheren Erläuterung der Erfindung, ohne dieselbe einzuschränken. Die Temperaturangaben beziehen sich auf Celsiusgrade. Sofern nicht anders vermerkt, ist bei der Nennung eines Wirkstoffs der Formel I, der in optisch aktiven Formen auftreten kann, stets das racemische Gemisch gemeint.

Beispiel 1



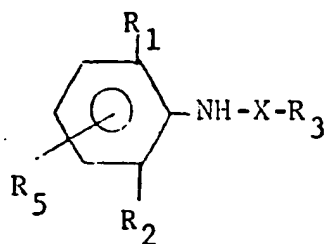
N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-crotonoyl-2,3-dimethyl-6-aethylanilin.

- a) 100 g 2,3-Dimethyl-6-aethylanilin, 223 g 2-Brompropionsäuremethylester und 84 g  $\text{NaHCO}_3$  wurden 17 Std. bei  $140^\circ$  gerührt, dann gekühlt, mit 300 ml Wasser verdünnt und mit Diäthyläther extrahiert. Der Extrakt wurde mit wenig Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und der Aether abgedampft. Nach dem Abdestillieren des überschüssigen 2-Brompropionsäuremethylesters wurde das Rohprodukt im Hochvakuum destilliert; Sdp.  $88-90^\circ \text{ C}/0,04 \text{ Torr}$ .
- b) 17 g des gemäss a) erhaltenen Ester, 10,4 g Crotonsäurechlorid 2 ml Dimethylformamid und 150 ml abs. Toluol wurden eine Stunde unter Rückfluss erhitzt. Nach dem Abdampfen des Lösungsmittels wurde das Rohprodukt im Vakuum destilliert. Sdp.  $128-129^\circ /0,03 \text{ Torr}$ .

Wenn man die reine D-Form des  $\alpha$ -(2,3-Dimethyl-6-aethylanilino)-propionsäuremethylesters mit Crotonsäure oder einem ihrer reaktionsfähigen Derivate acyliert, erhält man die D-Formen der beiden cis/trans-Isomeren (Verb. 141a und 141b).

2515113

Auf eine zu Beispiel 1a) analoge Art werden auch die übrigen Zwischenprodukte hergestellt, darunter z.B. die folgenden der Formel IIa: ( $R_1=2$ -Stellung)



(IIa)

$R_1$	$R_2$	$R_5$	$-X-R_3$	Physikalische Konstante
$CH_3$	$CH_3$	H	$-CH(CH_3)-COOCH_3$	Sdp. $98^\circ/0.8$ Torr
$CH_3$	$C_2H_5$	H	" "	Sdp. $88-90^\circ/0.01$ Torr
$CH_3$	$C_2H_5$	5- $CH_3$	" "	Sdp. $96-99^\circ/0.03$ Torr
$CH_3$	$CH_3$	3- $CH_3$	" "	Sdp. $83^\circ/0.03$ Torr; $145^\circ/9$ Torr
$CH_3$	$CH_3$	4- $CH_3$	" "	Sdp. $88-90^\circ/0.04$ Torr
$CH_3$	$C_2H_5$	3- $CH_3$	" "	Sdp. $88-90^\circ/0.04$ Torr
$CH_3$	H	4- $CH_3$	" "	Sdp. $95-100^\circ/0.02$ Torr
$CH_3$	H	5- $CH_3$	" "	Sdp. $106-108^\circ/0.1$ Torr
$CH_3$	H	3- $CH_3$	" "	Sdp. $146^\circ/5$ Torr
$isoC_3H_7$	H	H	" "	Sdp. $110^\circ/0.2$ Torr
$isoC_3H_7$	$isoC_3H_7$	H	" "	Sdp. $105^\circ/0.5$ Torr
$t.C_4H_9$	H	H	" "	Sdp. $93^\circ/0.07$ Torr
$CH_3$	H	4-Cl	" "	Sdp. $125-127^\circ/0.07$ Torr
$CH_3$	Cl	H	" "	Sdp. $88-89^\circ/0.03$ Torr
$CH_3$	$CH_3$	4-Br	" "	Smp. $31,5-32,5^\circ$
$CH_3$	$CH_3$	3-Br	" "	Smp. $46-47,5^\circ$
F	H	H	" "	Sdp. $98^\circ/0.15$ Torr
Cl	H	H	" "	Sdp. $90-100^\circ/0.09$ Torr
Br	H	H	" "	Sdp. $110^\circ/0.01$ Torr

509843/0963

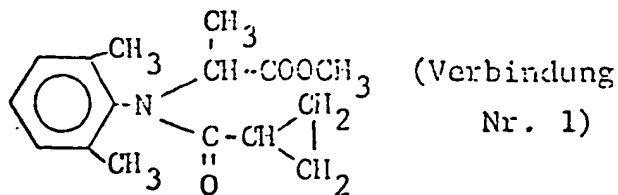
2515113

$R_1$	$R_2$	$R_5$	$-X-R_3$	Physikalische Konstante
J	H	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3) - \text{COOCH}_3$	Sdp. 105°/0.15Torr
$n\text{C}_4\text{H}_9\text{O}-$	H	H	" "	Sdp. 132°/0.5Torr
$\text{CH}_3$	H	4- $\text{CH}_3\text{O}-$	" "	Sdp. 131°/0.5Torr
$\text{CH}_3$	H	4sec.- $\text{C}_4\text{H}_9\text{O}-$	" "	Sdp. 138°/0.15Torr
Cl	H	5-Cl	" "	Smp. 51,5-54°
$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3) - \text{CONH}_2$	Sdp. 155-157°/0.1Torr
$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3) - \text{CONH}_2$	Smp. 71-73°
$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	H	$-\text{CH}_2 - \text{CONH}_2$	Smp. 103-106°
$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	H	$-\text{CH}_2 - \text{COOC}_2\text{H}_5$	Sdp. 100-103°/0.04Torr
$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	H	$-\text{CH}_2 - \text{CON}(\text{CH}_3)_2$	wachsartig
$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	$-\text{CH}_2 - \text{CONH}_2$	Smp. 89-91°
$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3) - \text{CONH}_2$	Smp. 102-103°
$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3) - \text{CONHCH}_3$	Smp. 75-76°
$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3) - \text{CON}(\text{CH}_3)_2$	Sdp. 104-108°/0.02Torr
$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	H	$-\text{CH}_2 - \text{CONHCH}_3$	Smp. 59-61,5°
$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	H	$-\text{CH}_2 - \text{CONHC}_2\text{H}_5$	Smp. 79-80°
$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	$-\text{CH}_2 - \text{COOCH}_3$	Sdp. 155-160°/20Torr
$\text{CH}_3$	Cl	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3) - \text{COOC}_2\text{H}_5$	Sdp. 110-120°/0.3Torr
$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	H	$-\text{CH}_2 - \text{COOCH}_3$	Sdp. 168-171°/30Torr
$\text{CH}_3$	Cl	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3) - \text{CONHCH}_3$	Smp. 51-53°

509843/0963

Beispiel 2

Herstellung von

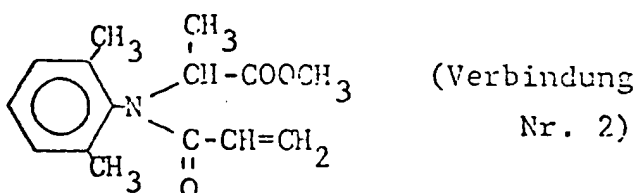


N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-cyclopropylcarbonyl-  
-2,6-dimethylanilin

51,8 g  $\alpha$ -(2,6-Dimethylanilino)-propionsäuremethylester in 200 ml abs. Toluol wurden unter Rühren bei Raumtemperatur mit 31,3 g Cyclopropancarbonsäurechlorid in 50 ml abs. Toluol versetzt. Nach Zugabe von 2 ml Dimethylformamid wurde zwei Stunden unter Rückfluss erhitzt und dann das Lösungsmittel und der Cyclopropancarbonsäurechlorid-Ueberschuss im Vakuum abdestilliert. Durch Anreiben mit etwas Petroläther wurde das zurückgebliebene Öl zur Kristallisation gebracht. Nach dem Umkristallisieren in Toluol-Petroläther schmolz die Verbindung Nr. 1 bei 84-87°.

Beispiel 3

Herstellung von



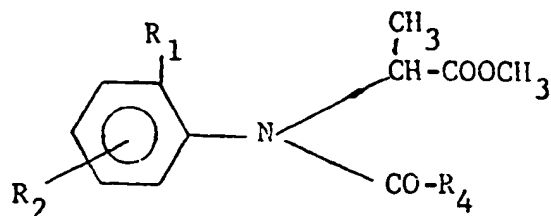
N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-vinylcarbonyl-2,6-di-  
methylanilin

Zu 166 g  $\alpha$ -(2,6-Dimethylanilino)-propionsäuremethylester und 70,4 g Pyridin in 600 ml abs. Toluol wurden unter gutem Rühren bei 20° 80,6 g Acrylsäurechlorid in 150 ml abs. Toluol zugetropft. Nach 20stündigem Rühren bei Raumtemperatur wurde vom ausgeschiedenen Pyridinhydrochlorid abfiltriert, das Lösungsmittel im Vakuum abdestilliert und dann das übriggebliebene Öl im Vakuum rektifiziert; Sdp. 130-135°/0,01 Torr (Verb.Nr. 2).

509843/0963

Auf diese Art oder nach einer der oben angegebenen Methoden  
werd. folgende Verbindungen der Formel Ib hergestellt:

(R<sub>1</sub> = 2-Stellung)






Verb. Nr.	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>4</sub>	Physikalische Konstante
1	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>		Smp. 84-87°
2	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH=CH <sub>2</sub>	Smp. 130-135°/0.01Torr
3	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 140°/0.01 Torr
4	CH <sub>3</sub>	4-Cl	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
5	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Smp. 64-67°
6	CH <sub>3</sub>	H	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub> (n)	
7	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> SCN	Smp. 101-103°
8	CH <sub>3</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
9	Cl	5-Cl	-CH <sub>2</sub> -CN	
10	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	Sdp. 108-110°/0.03Torr
11	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Smp. 78-80°
12	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)	Smp. 49-51°
13	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (iso)	Smp. 122-123°
14	CH <sub>3</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (iso)	Smp. 93-95°
15	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub> (n)	Sdp. 140-142°/0.05Torr
16	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> (iso)	Sdp. 138-140°/0.03 Torr.
17	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> (n)	Sdp. 140°/0.25 Torr
18	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (iso)	Sdp. 133°/0.4 Torr
19	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	-CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Sdp. 136-142°/0.03Torr

509843/0963

2515113

Verb. Nr.	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>4</sub>	Physikalische Konstante
20	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Smp. 71-72°
21	CH <sub>3</sub>	6-Cl	-CH <sub>3</sub>	Sdp. 123°/0.07 Torr
22	CH <sub>3</sub>	6-Cl	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)	Sdp. 170°/0.04 Torr
23	CH <sub>3</sub>	6-Cl	-CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Smp. 70-71°
24	CH <sub>3</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Sdp. 135-136°/0.1Torr
25	CH <sub>3</sub>	6-Cl	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (iso)	Smp. 90-93°
26	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -O-	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (iso)	Smp. 96-98°
27	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (iso)	Smp. 62-64°
28	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	-CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Smp. 74-76°
29	nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -O-	H	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (iso)	Sdp. 152°/0.05 Torr
30	nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -O-	H	-CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Sdp. 145°/0.05 Torr
31	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	6-isoCH <sub>3</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (iso)	Sdp. 133°/0.1 Torr
32	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	6-isoCH <sub>3</sub>	-CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Sdp. 147°/0.03 Torr
33	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	6-isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> (n)	Sdp. 143°/0.03 Torr
34	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -O-	-CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Sdp. 154°/0.6 Torr
35	F	H	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (iso)	Sdp. 118-122°/0.35Torr
36	F	H	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> (iso)	Sdp. 105°/0.04 Torr
37	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Smp. 80-82°
38	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sup. 118°/0.07 Torr
39	CH <sub>3</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 130-132°/0.05Torr
40	CH <sub>3</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 128°/0.07 Torr
41	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 136-138°/0.04Torr


















509843/0963

Verb. Nr.	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>4</sub>	Physikalische Konstante
42	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 135°/0.07 Torr
43	CH <sub>3</sub>	H	-CH=CH <sub>2</sub>	Oel
44	CH <sub>3</sub>	H	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 130°/0.05 Torr
45	CH <sub>3</sub> -O-	H	-CH=CH <sub>2</sub>	Sdp. 138-139°/0.02Torr
46	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 122-123°/0.05Torr
47	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 147°/0.09 Torr
48	CH <sub>3</sub>	6-Cl	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 141°/0.03 Torr
49	CH <sub>3</sub>	6-Cl	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Smp. 106-113°
50	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 129-131°/0.03 Torr
51	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 129-131°/0.03Torr
52	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	Sdp. 143-145°/0.04Torr
53	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -O-	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 148-150°/0.1Torr
54	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 142°/0.3 Torr
55	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 147°/0.35 Torr
56	nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -O-	H	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 160°/0.05 Torr
57	nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -O-	H	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 157°/0.05 Torr
58	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	6-isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 140°/0.1 Torr
59	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	6-isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 170°/0.1 Torr
60	F	H	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 125°/0.3 Torr
61	F	H	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 126-131°/0.35Torr
62	Cl	H	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 118-122°/0.05Torr
63	Br	H	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 140°/0.04 Torr
64	Br	H	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 138°/0.04 Torr
65	Cl	H	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 132°/0.01 Torr
66	CH <sub>3</sub>	6-Cl		Sdp. 140-142°/0.04Torr
67	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>		Sdp. 138-140°/0.05Torr
68	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>		Sdp. 137-138°/0.07Torr

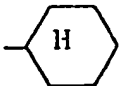
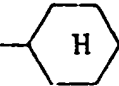
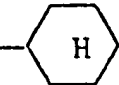
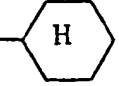
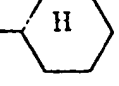
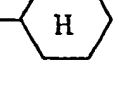


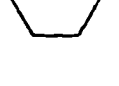
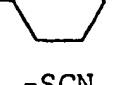
509843/0963



2515113

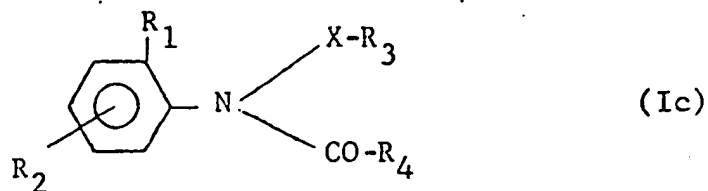
Verb. Nr.	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>4</sub>	Physikalische Konstante
69	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		Smp. 43-45°
70	CH <sub>3</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		Smp. 71-76°
71	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -O-		Smp. 82-83°
72	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>		Sdp. 142°/0.03 Torr
73	CH <sub>3</sub>	4-sec - C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -O-		Sdp. 156°/0.04 Torr
74	tert. C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H		Sdp. 150-152°/0.1 Torr
75	nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -O-	H		Sdp. 149-151°/0.04 Torr
76	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H		Sdp. 135°/0.03 Torr
77	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	6-iso-CH <sub>3</sub>		Sdp. 138°/0.03 Torr
78	F	H		Sdp. 125°/0.03 Torr
79	Cl	H		Sdp. 140°/0.06 Torr
80	J	H		Sdp. 143°/0.15 Torr
81	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>		Smp. 92-96°
82	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>		Smp. 116-121°
83	CH <sub>3</sub>	6-Cl		Smp. 105-108°
84	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>		Smp. 138-140°
85	CH <sub>3</sub>	6-Cl		Smp. 129-130,5°

509843/0963

Verb. Nr.	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>4</sub>	Physikalische Konstante
86	CH <sub>3</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		Smp. 125-127°
87	nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -O-	H		Smp. 73-74,5°
88	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>		Smp. 51-54°
89	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H		Sdp. 145°/0.04 Torr
90	tert.C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H		Sdp. 152-155°/0.06Torr
91	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>		Smp. 69-72°
92	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -O-		wachsartig
93	F	H		Sdp. 132°/0.05 Torr
94	Br	H		Sdp. 135-145°/0.05Torr
95	Cl	H		Smp. 102-104°
96	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -SCN	Smp. 68-72°
97	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> SCN	Smp. 86-88°




509843/0963

Nach Art der Beispiele 1-3 oder nach einer der oben angegebenen Methoden werden auch folgende Verbindungen der Formel Ic hergestellt:  
(R<sub>1</sub>=2-Stellung)



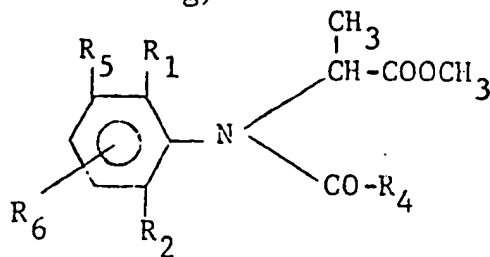
Verb. Nr.	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	-X-R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Physikalische Konstante
98	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH-CONH <sub>2</sub>   CH <sub>3</sub>		Smp. 142,5-144°
99	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH-CONH <sub>2</sub>   CH <sub>3</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Smp. 175-177°
100	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CONH <sub>2</sub>		Smp. 140,5-143°
101	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   CH <sub>3</sub>	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 115-120° / 0,08 Torr
102	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH-CONHCH <sub>3</sub>   CH <sub>3</sub>	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Smp. 114-115°
103	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH-CONHCH <sub>3</sub>   CH <sub>3</sub>		Smp. 131-134°
104	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH-CONH <sub>2</sub>   CH <sub>3</sub>	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Smp. 149-150°
105	CH <sub>3</sub>	6-Cl	-CH-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   CH <sub>3</sub>	-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 146-150°
106	CH <sub>3</sub>	6-Cl	-CH-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   CH <sub>3</sub>	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Smp. 88-92°
107	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Smp. 55-57°
108	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Smp. 72,5-73°
109	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH-CONH <sub>2</sub>   CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	Smp. 141-142°
110	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CONHCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	Smp. 123-124°

509843/0963




Verb. Nr.	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	-X-R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	Physikalische Konstante
111	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CONHCH <sub>3</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Smp. 183-184°
112	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		Smp. 71-74°
113	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		n <sub>D</sub> <sup>20</sup> 1.6859
114	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	Smp. 137-139°
115	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CCOCH <sub>3</sub>		Sdp. 132-134° 0,03Torr
116	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CCOCH <sub>3</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)	Sdp. 167-170° 0.4 Torr
117	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	Sdp. 170°/0.5 Torr
118	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CONHCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	Smp. 129-130°
119	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CONHCH <sub>3</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)	Smp. 63-65°
120	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CONH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	Smp. 138°
121	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Sdp. 130°/0.01 Torr
122	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CONHCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Smp. 80-86°
123	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CONHCH <sub>3</sub>	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Smp. 107-109°
124	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CONH <sub>2</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)	Smp. 103°
125	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	Smp. 73-74°
126	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> (iso)	Sdp. 152°/ 0.01Torr

509843/0963





Nach Art der Beispiele 1-3 oder nach einer der oben angegebenen Methoden werden auch folgende Verbindungen der Formel Id hergestellt: ( $R_1=2$ -Stellung)



(Id)

Verb. Nr.	$R_1$	$R_2$	$R_5$	$R_6$	$R_4$	Physikalische Konstante
127	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	4- $\text{CH}_3$	$-\text{C}_3\text{H}_7(\text{n})$	Smp. 65-66,5°
128	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$	Sdp. 150-152° / 0,06 Torr
129	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	$-\text{C}_3\text{H}_7(\text{n})$	Sdp. 143-145° / 0,03 Torr
130	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$	Sdp. 138-140° / 0,1 Torr
131	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	$-\text{C}_3\text{H}_7(\text{n})$	Sdp. 130-132° / 0,04 Torr
132	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H		Sdp. 130-132° / 0,04 Torr
133	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	Br	H	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$	Sdp. 155-160°
134	$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{CH}_3$	H	$-\text{C}_3\text{H}_7(\text{n})$	
135	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	4- $\text{CH}_3$	$-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	
136	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	$-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	
137	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	5- $\text{CH}_3$	$-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	
138	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	5- $\text{CH}_3$	$-\text{C}_3\text{H}_7(\text{n})$	Sdp. 174-177° / 0,04 Torr
139	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	5- $\text{CH}_3$	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$	Sdp. 184-189°
140	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	5- $\text{CH}_3$		0,03 Torr
141	$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{CH}_3$	H	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$	Sdp. 128-129° / 0,03 Torr
142	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	4- $\text{CH}_3$	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$	Sdp. 138-140° / 0,1 Torr
143	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	H	4- $\text{CH}_3$		Smp. 88,5-89,5°

509843/0963

Verb. Nr.	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>5</sub>	R <sub>6</sub>	R <sub>4</sub>	Physikalische Daten
144	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	4-Cl	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)	Sdp. 147-149° / 0,03 Torr
145	CH <sub>3</sub>	Cl	H	4-Cl		Sdp. 162-165° / 0,02 Torr
146	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	4-Br		Smp. 122-123,5°
147	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	4-Cl	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 152-154° / 0,04 Torr
148	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	4-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	
149	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	
150	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	4-Cl		Sdp. 172-174° / 0,02 Torr
151	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	4-Br	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Smp. 110-112°
152	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	4-Br	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)	Smp. 102-105°
153	CH <sub>3</sub>	Cl	H	4-Cl	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)	Sdp. 189-193° / 0,02 Torr
154	CH <sub>3</sub>	Cl	H	4-Br		
155	CH <sub>3</sub>	Cl	H	4-Br	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)	Sdp. 187-190° / 0,03 Torr
156	CH <sub>3</sub>	Cl	H	4-Cl	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 187-190° / 0,01 Torr
157	CH <sub>3</sub>	Cl	H	4-Br	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	Sdp. 193-195° / 0,02 Torr

509843/0963

Die Verbindungen der Formel I können zur Verbreiterung ihres Wirkungsspektrums mit anderen geeigneten Pestiziden oder den Pflanzenwuchs fördernden Wirkstoffen eingesetzt werden.

Als Mischkomponenten, die je nach Einsatzgebiet in Frage kommen, seien folgende bekannte Mikrobizide genannt, wobei teilweise synergistisch gesteigerte Wirkungen erzielt werden:

Elementarer Schwefel  
 Ammoniumpolysulfid  
 Natriumpolysulfid  
 Bariumpolysulfid  
 Calciumpolysulfid und Calciumthiosulfat  
 Calciumhypochlorit  
 Borsäure  
 Natriumtetraborat-dekahydrat (BORAX)  
 Zinkchlorid  
 Magnesiumborat  
 Nickelsulfat  
 Kaliumchromat  
 Bleiarsonat  
 Cadmiumchlorid  
 Cadmiumcarbonat  
 Kupfer(I)oxyd (KUPFEROXID)  
 Bordeaux-Brühe  
 Kupfer(II)sulfat-pentahydrat (KUPFERSULFAT)  
 Basisches Kupfer(II)chlorid (KUPFEROXICHLORID)  
 Kupfer(II)phosphat  
 Tribasisches Kupfer(II)sulfat (DREIBASISCHES KUPFERSULFAT)  
 Basisches Kupfer(II)carbonat (KUPFERCARBONAT)  
 Kupfer(II)-dihydrazin-sulfat  
 Kupferaminkomplexe  
 Kupfer(II)sulfat-Ammoniumcarbonat-Mischung  
 Kupfer(II)chlorid-basisches Kupfer(II)sulfat-Mischung  
 Basisches Kupfer(II)carbonat-Zinksalz-Mischung  
 Kupfer(II)-Zink-chromat-Komplex (KUPFER ZINK CHROMAT)  
 Kupfer(II)-Zink-cadmium-calcium-chromat-Komplex  
 Kupfer(II)Salz der Gelsäure (KUPFEROLEAT)  
 Kupfer(II)salze von Fettsäuren  
 Kupfer(II)salz der Naphthensäure  
 Kupfer(II)salz des 8-Hydroxychinolins  
 Kupfer(II)salz des 1,2-Naphthochinonoxims-(2)  
 Kupfer(II)salz des 3-Phenylsalicylats  
 Bis-(tri-n-butylzinn)oxid  
 Triphenylzinhydroxyd (MENTINHYDROXYD)  
 Triphenylzinnacetat (FENTINACETAT)  
 Bis-(tributylzinn)succinat  
 Quecksilber(I)chlorid (KALOMEL)  
 Quecksilber(I)chlorid  
 Quecksilber (II)oxyd  
 Quecksilber-Zink-chromat-Komplex  
 Quecksilber(II)lactat  
 Äthylquecksilberchlorid  
 2-Hydroxyäthylquecksilberacetat  
 Äthylquecksilberisothiocyanat  
 3-Aethoxypropylquecksilberbromid  
 Chloroethoxypropylquecksilberacetat  
 Methoxyäthylquecksilberchlorid  
 2-Methoxyäthylquecksilbersilikat  
 Bis-(äthylquecksilber)sulfat  
 Bis-(äthylquecksilber)ammoniumacetat  
 Äthylquecksilberacetat  
 2-Methoxyäthylquecksilberacetat  
 Äthylquecksilberphosphat  
 Isopropyläthylquecksilberacetat



Methylquecksilbercyanid  
 Methylquecksilberbenzoat  
 N-Cyano-N'-(methylquecksilber)guanidin  
 Methylquecksilberpentachlorphenolat  
 Aethylquecksilber-2,3-dihydroxypropylmerkaptid  
 Methylquecksilber-8-hydroxychinolat (Ortho LI)  
 N-(Methylquecksilber)-1,4,5,6,7,7-hexachlorobicyclo [2.2.1]hept-5-en-2,3-dicarboximid  
 N-(Aethylquecksilber)-1,4,5,6,7,7-hexachlorobicyclo[2.2.1]hept-5-en-2,3-dicarboximid  
 Natriumsalz des Aethylquecksilberthiosalicylats  
 N-(Aethylquecksilber)-p-toluolsulfonsäureanilid  
 Phenylquecksilberacetat (PAM)  
 Phenylquecksilberpropionat  
 Phenylquecksilbertriäthanolammoniumlactat (PAS)  
 Phenylquecksilberharnstoff  
 N-(Phenylquecksilber)-1,4,5,6,7,7-hexachlorobicyclo [2.2.1]hept-5-en-2,3-dicarboximid  
 Phenylquecksilberdimethyldithiocarbamat  
 Phenylquecksilberformamid  
 Phenylquecksilberchlorid  
 Phenylquecksilberacetat  
 Phenylquecksilbertennoat  
 Phenylquecksilberborat  
 Phenylquecksilberhydroxyd  
 Phenylquecksilberjodid  
 Basisches Phenylquecksilbernitrat  
 Phenylquecksilbermonoäthanolaminlactat  
 Phenylquecksilbersalicylat  
 Hydroxyquecksilberchlorphenol  
 Hydroxyquecksilbertrichlorphenol  
 Hydroxyquecksilbernitrophenol  
 N-Phenylquecksilberäthylendiamin  
 Phenylquecksilbermonoäthanolammoniumacetat  
 Pyridylquecksilberacetat  
 Diphenylquecksilber-2-hydroxychinolat  
 Quecksilber(II)-Komplex mit organische Phosphaten  
 Mischung von Methylquecksilber-2,3-dihydroxypropylmerkaptid und Methylquecksilberacetat  
 Mischung von Aethylquecksilber-2,3-dihydroxypropylmerkaptid und Aethylquecksilberacetat  
 Mischung von Hydroxyquecksilberchlorphenol und Hydroxyquecksilbernitrophenol  
 Quecksilber-Cadmium-organischer Komplex  
  
 Cadalumsuccinat  
 Cadmium-di-n-propyl-xanthogenat  
 Cadmium-8-hydroxychinolat  
 Phenylaminocadmiumacetat  
 Phenylaminocadmiumdi-lactat  
 Methylarsinsulfid  
 Zinkoktat  
 Zinkoleat  
 Formalin  
 Paraformaldehyd  
 Acrolein  
 Methylbromid  
 Methylisothiocyanat  
 Tetra jodäthylen  
 1,3-Dichlorpropen und verwandte chlorierte C<sub>3</sub>-Kohlenwasserstoffe  
 1-Chlor-3-brompropen(i)

509843/0963

trans-1,4-Dibrombuten(2)  
 1,3-Dichlorpropen(1)  
 1-Chlor-2-nitro-propan  
 2-Chlor-1-nitropropan  
 Trichlornitromethan  
 Dichlortetrafluoracetan  
 Natriumsalz der Propionsäure  
 Calciumsalz der Propionsäure  
 Chlorfurnarsäure-bis-?-chloräthylester  
 Sorbinsäure und deren Kaliumsalz  
 2-Propen-1,1-diolacetat  
 2-Aminobutan  
 Dodecylguanidinacetat (dodine)  
 Dodecylguanidinphthalat  
 α-Chloracetyl-1,3-aminopropionitril  
 α-Bromacetylvalinamid  
 1,2-Dichlor-1-(ethylsulfonyl)-äthylen  
 1,2-Dichlor-1-(butylsulfonyl)-äthylen  
 trans-1,2-Bis-(n-propylsulfonyl)-äthylen  
  
 p-Dichlortenzol  
 Hexachlortenzol (HCB)  
 1,2,4,5-Tetrachlor-4-nitrobenzol (TECHAZEN)  
 Pentachlornitrobenzol (CINIZEN)  
 1,3,4-Trichlor-2,4,6-trinitrobenzol  
 Isomerenmisch von 1,3,4-Trichlor-2,6-dinitrobenzol und 1,2,3-Trichlor-4,6-dinitrobenzol  
 2,4,5,6-Tetrachlorisophtalsäurenitril  
 2,4-Dinitrophenyl-thiocyanat  
 Diphenyl  
 O-Nitrodiphenyl  
 1-Chlor-2,4-dinitronaphthalin  
 Acenaphthen  
 2,4,6-Trichlorphenol  
 2,4,5-Trichlorphenol  
 2,4,5-Trichlorphenylacetat  
 2,4,5-Trichlorphenyl-chloracetat  
 Trichlorphenol, Zinksalz  
 m-Kresylacetat  
 2,3,4,6-Tetrachlorphenol  
 Pentachlorphenol (PCP)  
 O-Dihydroxybenzol  
 2,4-Dioxy-n-hexylbenzol  
 2-Phenylphenol  
 3,5-Dibromsalicylaldehyd  
 2-Benzyl-4-chlorphenol  
 2,2'-Dihydroxy-5,5'-dichlor-diphenylmethan (DICHLOPHEN)  
 2,2'-Dihydroxy-3,3',5,5',6,6'-hexachlor-diphenylmethan  
 2,2'-Dihydroxy-5,5'-dichlor-diphenylsulfid  
 2,2'-Dihydroxy-3,3',5,5'-tetrachlor-diphenylsulfid  
 2,2'-Dihydroxy-3,3',5,5'-tetrachlor-diphenylsulfid-di-Natriumsalz  
 4-Chlor-O-phenylphenol  
 1,4-Dichlor-2,5-diethoxybenzol (CHLORNEB)  
 Salicylanilid  
 Methylsalicylat  
 Mit Chlor oder Brom halogeniertes Trifluormethylsalicylanilid

Bromiertes Salicylanilid

(3,5-Dimethyl-4-chlorphenoxy)-Äthanol  
2-(1-Methyl-n-propyl)-4,6-dinitrophenyl-2-methylcrotonat (BIMAPACRYL)  
2-(1-Methyl-n-propyl)-4,6-dinitrophenylisopropylcarbonat (DILIBUTON)  
2-(1-Methyl-n-heptyl)-4,6-dinitrophenylcrotonat (DINOCAP)  
Methyl-2,6-dinitro-4-(1-Äthyl-hexyl)phenylcarbonat + Methyl-2,6-dinitro-4-(1-propyl-pentyl)phenylcarbonat (DINOCOTON)  
4-Konyl-2,6-dinitro-phenylätyrat  
S-Methyl-2-(1-methyl-n-heptyl)-4,6-dinitrophenylthiocarbonat

2,6-Dichlor-4-nitroanilin (DICHLOGRAN)

2-Cyanoäthyl-N-phenylcarbamat

Propenyl-N-phenylcarbamat

α-(2-Bromacetoxy)-acetanilid

2,3,5,6-Tetrachlor-benzochinon(1,4) (CHLORANIL)

2,3-Dichlor-naphthochinon(1,4) (DICHLON)

2-Amino-3-chlor-naphthochinon(1,4)

2-Chlor-3-acetamino-naphthochinon(1,4)

4-Methyl-2,3,5,10-tetrahydro-3,5,10-trioxo-4H-1-naphtho (1,3,-b)-1,4-triazin

2,3,6,7-Tetrachloro-4a,6a-epoxy-1,2,3,4,4a,8a-hexahydro-1,4-cethanonaphthalin-5,8-dion

Chinonoximbenzylhydrazon (SEMQUINOX)

N-(Trichloromethylthio)phthalimid (FOLPET)

N-(Trichloromethylthio)cyclohex-4-en-1,2-dicarboximid (CAPTAN)

N-(1,1,2,2-tetrachloräthylthio)cyclohex-4-en-1,2-dicarboximid (CAPTAFL)

N-Methansulfonyl-N-trichloromethylthio-p-chloranilin

N'-Dichlorfluormethylthio-N,N-dimethyl-N'-phenylsulfamid (DICHLOFLUAMID)

S-(2-Pyridyl-1-oxyl)-S'-trichloromethyl-disulfid; Hydrochlorid

0,0,0-Trimethylthiophosphat

0,0-Diäthyl-phthalimidophosphonothioat

5-Amino-bis-(dimethylanido)phosphinyl-3-phenyl-1,2,4-triazol (TRIAMIPHOS)

5-Methylamino-bis-(dimethylanido)phosphinyl-3-phenyl-1,2,4-triazol

0,0-Diäthyl-0-2-pyrazinyl-phosphorithioat

0-Aethyl-S,S-diphenyl-dithiophosphat

0-Aethyl-S-benzyl-phenyldithiophosphonat

0,0-Diäthyl-S-benzyl-thiophosphat

Zinksalz der Dithiocarbaminsäure

Natrium-N-methyl-dithiocarbamat (METHAM)

Natrium-N-methoxyäthyl-dithiocarbamat

Natrium-N,N-dimethyl-dithiocarbamat (DDC)

Ammonium-N,N-dimethyl-dithiocarbamat

Zink-N,N-dimethyl-dithiocarbamat (ZIRAM)

Eisen-N,N-dimethyl-dithiocarbamat (FERSA)

Kupfer-N,N-dimethyl-dithiocarbamat

Dinatrium-äthylen-1,2-bis-dithiocarbamat (NABAM)

Zink-äthylen-1,2-bis-dithiocarbamat (ZINEB)

Eisen-äthylen-1,2-bis-dithiocarbamat

Mangan(II)-äthylen-1,2-bis-dithiocarbamat (MANEB)

Calcium-äthylen-1,2-bis-dithiocarbamat

Ammonium-äthylen-1,2-bis-dithiocarbamat

Zink-propylen-1,2-bis-dithiocarbamat (MEZINEB) (PROPINEB)

Bis (diethylthiocarbonyl)-äthylen-1,2-bis-dithiocarbamat

Komplex bestehend aus (MANEB) und Zinksalz (MANCOZEB)

Tetraäthylthiuran monosulfid

Bis-(N,N-dimethyldithiocarbonylmerkapto)-methylarsin

Tetramethylthiurandisulfid (THIRAM)

509843/0963

Dipyrrolidylthiurandisulfid  
 N,N'-Bis-(dimethylanino)thiurandisulfid  
 Polyäthylenthaurandisulfid  
 Komplex bestehend aus (ZIF9) und polyäthylenthaurandisulfid (METIRAM)  
 Bis-(3,4-dichlor-2(5)-furanoyl)äther (mucochloric anhydric)  
 2-Methoxyethyl-5-nitrofuran  
 5-Nitro-furfuraldoxin-(2)  
 5-Nitro-furfuryl-anidoxin-(2)  
 1-Oxy-3-acetyl-6-methyl-cyclohexen-(5)dien-(2,4) (dehydroacetic acid)  
 3-[-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyäthyl]-glutarimid (cyclohexalide)  
 Phthalimid  
 Pyridin-2-thiol-1-oxd-bzw. 1-Hydroxypyridin-2-thion  
 Zinksalz des Pyridin-2-thiol-1-oxys  
 Mangan(II)salz des Pyridin-2-thiol-1-oxys  
 S-1(1-Oxid-2-pyridyl)isothiuroniumchlorid  
 α,α-bis(4-Chlorphenyl)-3-pyridinethanol (PARINOL)  
 8-Hydroxychinolin (8-HYDROXYCHINOL)  
 8-Hydroxychinolin-sulfat (CHINOSUL)  
 Benzoyl-8-Hydroxychinolin-salicylat  
 3-(2-Methylpiperidino)propyl-3,4-dichlorbenzoat  
 6-Aethoxy-1,2-dihydro-2,2,4-trimethylchinolin (ETHOXYQUIN)  
 N-Lauryl-isochinolinurbinonid  
 9-(p-n-Hexyloxyphenyl)-10-methyl-acridiniumchlorid  
 9-(p-n-Hexyloxyphenyl)-10-methyl-acridinium-p-toluolsulfonat  
 2-n-Hepta-decylimidazolacetat (OLYDOL)  
 1-Hydroxyäthyl-2-hepta-decylimidazolidin  
 1-Phenyl-3,5-dimethyl-4-nitrosopyrazol  
 1-p-Chlorphenyl-3,5-dimethyl-4-nitrosopyrazol  
 1-p-Sulfarylphenyl-3,5-dimethyl-4-nitrosopyrazol  
 N-(1-Phenyl-2-nitropropyl)piperazin  
 2-Dimethylanino-6-methyl-5-n-butyl-4-hydroxy-pyrimidin  
 N-Dodecyl-1,4,5,6-tetrahydropyrimidin  
 N-Dodecyl-2-methyl-1,4,5,6-tetrahydropyrimidin  
 2-n-Hepta-decyltetrahydropyrimidin  
 1-(4-Amino-4-propyl-5-pyrimidyl-methyl)-2-methylpyridiniumchloridhydroxychlorid  
 2-(2'-Furyl)-benzimidazol (FURIDAZOL)  
 3-Dodecyl-1-methyl-2-phenylbenzimidazolium-ferricyanid  
 Methyl-N-benzimidazol-2-yl-N-(butylcarbamoyl)carbamat (BENOMYL)  
 2-(0-Chloranilino)-4,6-dichlor-syn.-triazin  
 2-Aethylamino-6-methyl-5-n-butyl-4-hydroxy pyrimidin  
 5-Chlor-4-phenyl-1,2-dithiol-3-on  
 2,3-Dicyano-1,4-dithia-anthrachinon (DITHIAKON)  
 2-(4-Thiazolyl)-benzimidazol  
 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazonon (DRAZOLON)  
 Thiazolidinen-4-thion-(2) (RHODANIN)  
 3-(p-Chlorphenyl)-5-methylrhodanin  
 3,5-Di-äthyltetrahydro-1,3,5-thiadiazin-2-thion (DAZOMET)  
 3,3'-Äthyl-bis-(tetrahydro-4,6-dimethyl)-2H-1,3,5-thiadiazin-2-thion (MILNEB)  
 3-Benzylidenamino-4-phenylthiazolin-2-thion  
 6-Chlorerzthiazol-2-thiol, Zinksalz  
 6-β-Diäthylamino-äthoxy-2-dimethylanino-benzthiazol dihydrochlorid  
 Monoäthanolammonium-benzthiazol-2-thiol  
 Laurylpyridinium-5-chlor-2-merkaptol-erzthiazol

509843 / 0963

Zink- und Natriumsalze des 2-Merkapto-5-benzothiazols und Dimethylthiocarbamat

6-( $\beta$ -Diäthylaminoäthoxy)-2-dimethylaminobenzthiazol-dihydrochlorid

3-Trichloroethylthiobenzthiazolon

3-Trichloroethylthiobenzoxazolon

3-(Trichloroethyl)-5-äthoxy-1,2,4-thiadiazol

6-Methyl-2-oxo-1,3-dithio[4,5-b]-chinoxalin (QUINOMETHIONAT)

2-Thio-1,3-dithio[4,5-b]-chinoxalin (THIOQUINOX)

2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathin

3,3,4,4-Tetrachlorotetrahydrothiophen-1,1-dioxyd

2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathin-4,4-dioxyd

Äthyl-triäthylammoniumbromid

n-Alkyl(C<sub>12</sub>, C<sub>14</sub>, C<sub>16</sub>) diäthylbenzylammoniumchlorid

Alkenyl-dimethyläthylammoniumbromid

Dialkyldimethylammoniumbromid

Alkyldiäthylbenzylammoniumchlorid

Alkyl C<sub>9</sub>-C<sub>15</sub> tolyltriäthylammoniumchlorid

Di-isobutylkresoxyäthoxyäthyl-diäthylbenzylammoniumchlorid

p-Di-isobutylphenoxyäthoxyäthyl-diäthylbenzylammoniumchlorid

Benzoyltriäthylammoniumbromid

Gliotoxin

2,4-Diguanidino-3,5,6-trihydroxycyclohexyl 5-deoxy-2-O-(2-deoxy-2-methylamino- $\alpha$ -L-glucopyranosyl)-3-C-fernyl- $\beta$ -L-lyxopentofuranosid (STREPTOMYCIN)

7-Chlor-4,6-dimethoxycumarin-3-on-2-spiro-1'-(2'-methoxy-6'-methylcyclohex-2'-en-4'-on) (GRISEOFULVIN)

4-Dimethylamino-1,4,4 $\alpha$ ,5,5 $\alpha$ ,6,11,12 $\alpha$ -octahydro-3,5,6,10,12,12 $\alpha$ -hexahydroxy-6-methyl-1,11-dioxo-2-naphthacencarboximid (OXYTETRACYCLIN)

7-Chlor-4-dimethylamino-1,4,4 $\alpha$ ,5,5 $\alpha$ ,6,11,12 $\alpha$ -octahydro-3,6,10,12,12 $\alpha$ -pentahydroxy-6-methyl-1,11-dioxo-2-naphthacencarboximid (CHLORTETRACYCLIN)

(PIVARICIN)

(LANCOMYCIN)

(PHLEOMYCIN)

(KASUGAMYCIN)

(PHYTOACTIN)

D(-)-threo-2,2-dichlor-N-[3-hydroxy- $\alpha$ -(hydroxymethyl)-p-nitrophen-äthyl]acetamid (CHLORAMPHENICOL)

Blasticidin-S-benzylanino-benzolsulfonat

N-(3-nitrophenyl)itaconimid

Phenyljessigsäure

Natrium-p-dimethylamino-benzoldiazosulfonat

Acrolein-phenylhydrazon

2-Chloracetaldehyd(2,4-dinitrophenyl)-hydrazon

2-Chlor-3-(tolylsulfonyl)-propionitril

1-Chlor-2-phenyl-pentan-diol(4,5)-thion(3)

p-Henylphenoxy-polyäthylenoxyäthanol-Jod-Komplex

( $\alpha$ -Nitroäthyl)-O-chlorbenzylthioäthylamin-hydrochlorid

3-(p.-t.-butyl-phenylsulfonyl)acrylonitril

Oktachlorcyclohexanon

Pentachlorbenzylalkohol

Pentachlorbenzylacetat

Pentachlorbenzaldehyd-cyanhydrin

2-Norcamphanmethanol

2,6-Bis-(diäthylaminomethyl)-cyclohexanon

Decachloroctahydro-1,3,4-metheno-2H-cyclobuta[cd]-pentalen-2-on

1-(3-Chlorallyl)-3,5,7-triaza-1-azoniaadamantanchlorid

Kohlenteer und Mochofenteer

509843 / 0963

Mischung Nickelsulfat-Maneb  
Mischung Maneb-Merkaptobenzthiazol  
Mischung Zineb-Merkaptobenzthiazol  
Mischung Zineb-Nickel(II)-chlorid  
Mischung Zineb-Nickel(II)-sulfat  
Mischung Ziram-basisches Kupfersulfat  
Mischung Ziram-Zink-merkaptobenzthiazol  
Mischung Thiram-Cadmiumchloridhydrat  
Mischung Thiram-Hydroxyquecksilberchlorphenol  
Mischung Thiram-Phenylquecksilberacetat  
Mischung Polyäthylen-bis-thiuransulfid-Kupferoxychlorid  
Mischung Methylarsin-bis-(dimethyldithiocarbanat)-ziram-thiram  
Mischung Folpet-Phenylquecksilberacetat  
Mischung Dodine-Fercam-Schwefel  
Mischung Dithianon-Kupferoxychlorid  
Mischung Dichlone-Fercam-Schwefel  
Mischung Dinocap-dinitrooctylphenol  
Mischung Captan-quintozene-tribasisches Kupfersulfat  
Mischung Cadmiumpropionat-Phenylquecksilberpropionat  
Formaldehyd-Harnstoff-Mischung  
Mischung Phenylammoniumcadmiundilactat-Phenylquecksilberformamid  
Mischung basisches Kupfersulfat-Zinksalze

509843/0963

Die Verbindungen der Formel I können für sich allein oder zusammen mit geeigneten Trägern und/oder anderen Zuschlagstoffen verwendet werden. Geeignete Träger und Zuschlagstoffe können fest oder flüssig sein und entsprechen den in der Formulierungstechnik üblichen Stoffen wie z.B. natürlichen oder regenerierten mineralischen Stoffen, Lösungs-, Dispergier-, Netz-, Haft-, Verdickungs-, Binde- oder Düngemitteln.

Der Gehalt an Wirkstoff in handelsfähigen Mitteln liegt zwischen 0,1 bis 90 %.

Zur Applikation können die Verbindungen der Formel I in den folgenden Aufarbeitungsformen vorliegen (wobei die Gewichtsprozentangaben in Klammern vorteilhafte Mengen an Wirkstoff darstellen):

Feste Aufarbeitungsformen: Stäubemittel und Streumittel (bis zu 10 %), Granulate, Umhüllungsgranulate, Imprägnierungsgranulate und Homogengranulate (1 bis 80 %);

Flüssige Aufarbeitungsformen:

a) in Wasser dispergierbare Wirkstoffkonzentrate:

Spritzpulver (wetable powders) und Pasten (25-90 % in der Handelspackung, 0,01 bis 15 % in gebrauchsfertiger Lösung);  
Emulsions- und Lösungskonzentrate (10 bis 50 %; 0,01 bis 15 % in gebrauchsfertiger Lösung);

b) Lösungen (0,1 bis 20 %);

Die Wirkstoffe der Formel I vorliegender Erfindung können beispielsweise wie folgt formuliert werden:

509843/0963

Stäubemittel: Zur Herstellung eines a) 5%igen und b) 2%igen Stäubemittels werden die folgenden Stoffe verwendet:

- a) 5 Teile Wirkstoff  
95 Teile Talkum;
- b) 2 Teile Wirkstoff  
1 Teil hochdisperse Kieselsäure,  
97 Teile Talkum;

Die Wirkstoffe werden mit den Trägerstoffen vermischt und vermahlen und können in dieser Form zur Anwendung verschickt werden.

Granulat: Zur Herstellung eines 5 %igen Granulates werden die folgenden Stoffe verwendet:

- 5 Teile Wirkstoff
- 0,25 Teile Epichlorhydrin,
- 0,25 Teile Cetylpolyglykoläther,
- 3,50 Teile Polyäthylenglykol
- 91 Teile Kaolin (Korngrösse 0,3 - 0,8 mm).

Die Aktivsubstanz wird mit Epichlorhydrin vermischt und mit 6 Teilen Aceton gelöst, hierauf wird Polyäthylenglykol und Cetylpolyglykoläther zugesetzt. Die so erhaltene Lösung wird auf Kaolin aufgesprüht, und anschliessend wird das Aceton im Vakuum verdampft. Ein derartiges Mikrogranulat wird vorteilhaft zur Bekämpfung von Bodenpilzen verwendet.

Spritzpulver: Zur Herstellung eines a) 70 %igen b) 40 %igen c) und d) 25 %igen e) 10 %igen Spritzpulvers werden folgende Bestandteile verwendet:

- a) 70 Teile Wirkstoff
- 5 Teile Natriumdibutyl-naphthylsulfonat,
- 3 Teile Naphthalinsulfonsäuren-Phenolsulfonsäuren-Formaldehyd-Kondensat 3:2:1,

509843/0963



- 10 Teile Kaolin,
- 12 Teile Champagne-Kreide;
  
- b) 40 Teile Wirkstoff
  - 5 Teile Ligninsulfonsäure-Natriumsalz,
  - 1 Teil Dibutylnaphtalinsulfonsäure-Natriumsalz,
  - 54 Teile Kieselsäure;
  
- c) 25 Teile Wirkstoff
  - 4,5 Teile Calcium-Ligninsulfonat,
  - 1,9 Teile Champagne-Kreide/Hydroxyäthylcellulose-Gemisch (1:1),
  - 1,5 Teile Natrium-dibutyl-naphthalinsulfonat,
  - 19,5 Teile Kieselsäure,
  - 19,5 Teile Champagne-Kreide,
  - 28,1 Teile Kaolin;
  
- d) 25 Teile Wirkstoff
  - 2,5 Teile Isooctylphenoxy-polyoxyäthylen-äthanol,
  - 1,7 Teile Champagne-Kreide/Hydroxyäthylcellulose-Gemisch (1:1),
  - 8,3 Teile Natriumaluminiumsilikat,
  - 16,5 Teile Kieselgur,
  - 46 Teile Kaolin;
  
- e) 10 Teile Wirkstoff
  - 3 Teile Gemisch der Natriumsalze von gesättigten Fettalkoholsulfaten,
  - 5 Teile Naphthalinsulfonsäure/Formaldehyd-Kondensat,
  - 82 Teile Kaolin;

Die Wirkstoffe werden in geeigneten Mischern mit den Zuschlagstoffen innig vermischt und auf entsprechenderden Mühlen und Walzen vermahlen. Man erhält Spritzpulver von vorzüglicher Benetzbarkeit und Schwebefähigkeit, die sich mit Wasser zu Suspensionen jeder gewünschten Konzentration verdünnen und insbesondere zur Blattapplikation verwenden lassen.

509843/0953

Emulgierbare Konzentrate: Zur Herstellung eines 25%igen emulgierbaren Konzentrates werden folgende Stoffe verwendet:

- |      |   |
|------|---|
| 25   | Teile Wirkstoff   |
| 2,5  | Teile epoxydiertes Pflanzenöl,                                      |
| 10   | Teile eines Alkylarylsulfonat/Fettalkoholpolyglykoläther-Gemisches, |
| 5    | Teile Dimethylformamid,   |
| 57,5 | Teile Xylol.  |

Aus solchen Konzentraten können durch Verdünnen mit Wasser Emulsionen jeder gewünschten Konzentration hergestellt werden, die besonders zur Blattapplikation geeignet sind.

#### Beispiel 4

Wirkung gegen Phytophthora infestans auf Solanum lycopersicum (=Tomaten).

---

##### Ia) Residual-präventive Wirkung

Solanum lycopersicum- Pflanzen der Sorte "Roter Gnom" werden nach 3-wöchiger Anzucht nach dem Besprühen mit einer 0,05 % Aktivsubstanz enthaltenden Brühe (hergestellt aus der zu einem Spritzpulver aufgearbeiteten Wirksubstanz) und deren Antrocknen mit einer Zoosporensuspension von Phytophthora infestans infiziert. Sie bleiben dann während 6 Tagen in einer Klimakammer bei 18 bis 20° und hoher Luftfeuchtigkeit, die mittels eines künstlichen Sprühnebels erzeugt wird. Nach dieser Zeit zeigen sich typische Blattflecken. Ihre Anzahl und Grösse sind der Bewertungsmaßstab für die geprüfte Substanz.

Ib) Kurative Wirkung

Tomatenpflanzen der Sorte "Roter Gnom" werden nach dreiwöchiger Anzucht mit einer Zoosporensuspension des Pilzes besprüht und in einer Kabine bei 18 bis 20° und gesättigter Luftfeuchtigkeit inkubiert. Unterbruch der Befeuchtung nach 24 Stunden. Nach dem Abtrocknen der Pflanzen werden diese mit einer Brühe besprüht, die die als Spritzpulver formulierte Wirksubstanz in einer Konzentration von 0,05 % enthält. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen wieder in der Feuchtkabine während 4 Tagen aufgestellt. Anzahl und Grösse der nach dieser Zeit auftretenden typischen Blattflecken sind der Bewertungsmassstab für die Wirksamkeit der geprüften Substanzen.

II) Präventiv-Systemische Wirkung

Die als Spritzpulver formulierte Wirksubstanz wird in einer Konzentration von 0,05 % (bezogen auf das Bodenvolumen) auf die Bodenoberfläche von drei Wochen alten eingetopften Tomatenpflanzen der Sorte "Roter Gnom" gegeben. Nach dreitägiger Wartezeit wird die Blattunterseite der Pflanzen mit einer Zoosporensuspension von *Phytophthora infestans* besprüht. Sie werden dann 5 Tage in einer Sprühkabine bei 18 bis 20° und gesättigter Luftfeuchtigkeit gehalten. Nach dieser Zeit bilden sich typische Blattflecken, deren Anzahl und Grösse zur Bewertung der Wirksamkeit der geprüften Substanzen dienen.

In diesen drei Versuchen zeigen die Verbindungen der Formel I starke blattfungizide Wirkung. Bei Applikation der Verbindungen der Untergruppe Ia mit R'=Methyl wird ein Pilzbefall von unter 20 % (Durchschnittswerte) beobachtet. Mit den Verbindungen Nr. 1, 2, 7, 12, 22, 37, 39, 49, 66, 81, 101, 102, 103, 119, 127, 130, 131, 132, 138, 139, 140, 141, 142, 144, 148 und anderen wird der Pilzbefall fast vollständig gehemmt (0-5 %).

509843/0963

Beispiel 5

Wirkung gegen *Plasmopara viticola* (Bert. et Curt.) (Berl. et DeToni) auf Reben

---

a) Residual-präventive Wirkung

Im Gewächshaus wurden Rebenstecklinge der Sorte "Chasselas" herangezogen. Im 10-Blatt-Stadium wurden 3 Pflanzen mit einer aus der als Spritzpulver formulierten Wirksubstanz hergestellten Brühe (0,05 % Wirkstoff) besprüht. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen auf der Blattunterseite mit der Sporensuspension des Pilzes gleichmässig infiziert. Die Pflanzen wurden anschliessend während 8 Tagen in einer Feuchtkammer gehalten. Nach dieser Zeit zeigten sich deutliche Krankheitssymptome an den Kontrollpflanzen. Anzahl und Grösse der Infektionsstellen an den behandelten Pflanzen dienten als Bewertungsmassstab für die Wirksamkeit der geprüften Substanzen.

b) Kurative Wirkung

Rebenstecklinge der Sorte "Chasselas" wurden im Gewächshaus herangezogen und im 10-Blatt-Stadium mit einer Sporensuspension von *Plasmopara viticola* an der Blattunterseite infiziert. Nach 24 Std. Aufenthalt in der Feuchtkabine wurden die Pflanzen mit einer 0,05igen Wirkstoffbrühe besprüht, die aus einem Spritzpulver des Wirkstoffs hergestellt worden war. Anschliessend wurden die Pflanzen 7 Tage weiterhin in der Feuchtkabine gehalten. Nach dieser Zeit zeigten sich die Krankheitssymptome an den Kontrollpflanzen. Anzahl und Grösse der Infektionsstellen an den behandelten Pflanzen dienten als Bewertungsmassstab für die Wirksamkeit der geprüften Substanzen.

509843/0963

Die Verbindungen der Formel I zeigten starke blattfungizide Wirkungen in diesen beiden Versuchen. Mit den Verbindungen der Untergruppe Ia ( $R' = \text{Methyl}$ ) wurde der Pilzbefall durchweg auf unter 20 % reduziert, teilweise, wie z.B. bei den Verbindungen Nr. 1,2,7,10,12,13,22,37,39,40,48,49,66,81,82, 150, 127,128,130, 131,132,136,142,143 und anderen trat fast kein Befall auf (0-5%).

#### Beispiel 6

##### Wirkung gegen Erysiphe graminis auf Hordeum vulgare (Gerste)

##### Residual-protektive Wirkung

Ca. 8 cm hohe Gerstenpflanzen wurden mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,05 % Aktivsubstanz) besprüht. Nach 48 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit Konidien des Pilzes bestäubt. Die infizierten Gerstenpflanzen wurden in einem Gewächshaus bei ca. 22° C aufgestellt und der Pilzbefall nach 10 Tagen beurteilt.

Ein Teil der Verbindungen der Formel I, z.B. die Verbindungen Nr. 33,34,50,56,57,58,69,73,74 und andere zeigen in diesem Test eine Reduktion des Pilzbefalls auf  $< 20 \%$ .

#### Beispiel 7

##### Wirkung gegen Pythium debaryanum an Beta vulgaris (Zuckerrübe)

##### a) Wirkung nach Bodenapplikation

Der Pilz wird auf sterilen Haferkörnern kultiviert und einer Erde-Sand-Mischung beigegeben. Die so infizierte Erde wird in Blumentöpfe abgefüllt und mit Zuckerrübensamen besät. Gleich nach der Aussaat werden die als Spritzpulver formulierten Versuchspräparate als wässrige Suspensionen über die Erde gegossen (20 ppm Wirkstoff bezogen auf das Erdvolumen).

509843/0963

Die Töpfe werden darauf während 2-3 Wochen im Gewächshaus bei 20-24° C aufgestellt. Die Erde wird dabei durch leichtes Besprühen mit Wasser gleichmässig feucht gehalten. Bei der Auswertung der Tests wird der Auflauf der Zuckerrübenpflanzen sowie der Anteil gesunder und kranker Pflanzen bestimmt.

b) Wirkung nach Beizapplikation

Der Pilz wird auf sterilen Haferkörnern kultiviert und einer Erde-Sand-Mischung beigegeben. Die so infizierte Erde wird in Blumentöpfe abgefüllt, und mit Zuckerrübensamen besät, die mit den als Beizpulver formulierten Versuchspräparaten gebeizt worden sind (1000 ppm Wirkstoff bezogen auf das Samengewicht). Die besäten Töpfe werden während 2-3 Wochen im Gewächshaus bei 20-24° C aufgestellt. Die Erde wird dabei durch leichtes Besprühen mit Wasser gleichmässig feucht gehalten. Bei der Auswertung wird der Auflauf der Zuckerrübenpflanzen sowie der Anteil gesunder und kranker Pflanzen bestimmt.

Nach der Behandlung mit den Wirkstoffen der Formel I liefen, sowohl unter den Testbedingungen a) wie b) mehr als 85 % der Zuckerrübenpflanzen auf und hatten ein gesundes Aussehen. Bei der unbehandelten Kontrolle liefen weniger als 20 % Pflanzen mit zum Teil kränklichem Aussehen auf.

Beispiel 8

Wuchshemmung an Gräsern

Auf einem etablierten Freiland-Rasen bestehend aus den Gräsern Lolium perenne, Poa pratensis und Festuca rubra wurden Parzellen von 3 m<sup>2</sup> Grösse zwei Tage nach dem ersten Schnitt im Frühjahr mit wässrigen Zubereitungen eines Wirkstoffs der Formel I besprüht. Die eingesetzte Wirkstoffmenge betrug umgerechnet 5 kg AS/pro Hektar. Unbehandelte Parzellen wurden als Kontrollen belassen. 6 Wochen nach der Applikation wurde die mittlere

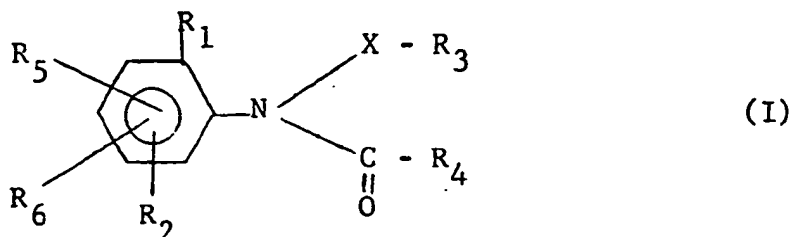
509843/0963

Wuchshöhe der Gräser in behandelten und unbehandelten Parzellen ermittelt. Die mit den Wirkstoffen behandelte Grasnarbe war gleichmässig kompakt und hatte ein gesundes Aussehen. Insbesondere Wirkstoffe der Formel I, worin  $-X-R_3$  den für Formel I definierten Rest  $-CO-N(R'')(R''')$  bedeutet, zeigten starke oder fast vollständige Wuchshemmung.

509843/0963

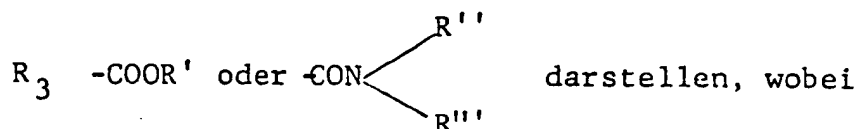
# Patentansprüche

## 1. Verbindungen der Formel I



worin

- $R_1$   $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder Halogen,  
 $R_2$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_3$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder Halogen,  
 $R_5$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_3$ -Alkyl oder Halogen  
 $R_6$  Wasserstoff oder Methyl sind, wobei die Gesamtzahl von C-Atomen der Substituenten  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_5$  und  $R_6$  im Phenylring die Zahl 8 nicht übersteigt,  
 $X$   $-CH_2$  oder  $-CH-$ ,  
 $\begin{array}{c} CH_3 \\ | \\ -CH- \end{array}$



$R'$ ,  $R''$  und  $R'''$  unabhängig voneinander Wasserstoff, Methyl oder Aethyl bedeuten und

$R_4$  ein gegebenenfalls durch Cyano oder Rhodano substituiertes  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_5$ -Alkenyl oder  $C_3$ - $C_7$ -Cycloalkyl bedeuten.

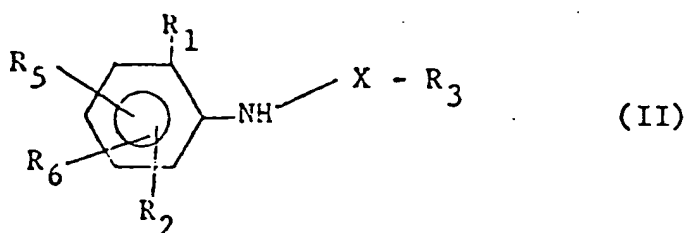
2. Verbindungen der Formel I gemäss Anspruch 1, bei denen  $R_1$  Methyl bedeutet,  $R_2$  in ortho-Position zur Aminogruppe steht und Methyl, Aethyl oder Chlor bedeutet,  $-X-R_3$  die Gruppierung  $\begin{array}{c} CH_3 \\ | \\ -CH-COOR' \end{array}$  darstellt, während  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_6$  und  $R'$  die angegebene Bedeutung haben.



3. Verbindungen der Formel I gemäss Anspruch 2, bei denen R' Methyl bedeutet, R<sub>4</sub> für einen Alkyl-, Alkenyl- oder Cycloalkylrest mit 2-4 C - Atomen steht und R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> die angegebene Bedeutung haben, wobei die Gesamtzahl von C-Atomen der Substituenten R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> im Phenylring die Zahl 4 nicht übersteigt.
4. Verbindungen der Formel I gemäss Anspruch 1, worin R<sub>2</sub> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl oder Halogen und die Substituenten R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> Wasserstoff bedeuten, während die Substituenten R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, X, R', R'' und R''' die für Formel I gegebene Bedeutung haben.
5. Verbindungen der Formel I gemäss Anspruch 1, bei denen R<sub>4</sub> eine Cyanomethyl- oder Rhodanomethyl-Gruppe bedeutet.
6. Verbindungen der Formel I gemäss Anspruch 1, bei denen R<sub>1</sub> Methyl oder Aethyl bedeutet, R<sub>2</sub> in ortho-Position zur Aminogruppe steht und Methyl, Aethyl oder Chlor bedeutet, -X-R<sub>3</sub> die Gruppierung -CH<sub>2</sub>-CON(R'')(R''') darstellt, während R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R'' und R''' die angegebene Bedeutung haben.
7. Die Verbindung N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-rhodanoacetyl-2,6-dimethylanilin gemäss Anspruch 1.
8. Die Verbindung N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-cyclopropanoyl-2,6-dimethylanilin gemäss Anspruch 1.
9. Die Verbindung N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-acryloyl-2,6-dimethylanilin gemäss Anspruch 1.
10. Die Verbindung N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-crotonoyl-2,6-dimethylanilin gemäss Anspruch 1.
11. Die Verbindung N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-crotonoyl-2-methyl-6-äthylanilin gemäss Anspruch 1.

509843/0963

12. Die Verbindung N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-cyclopropanoyl-2-methyl-6-chloranilin gemäss Anspruch 1.
13. Die Verbindung N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-crotonoyl-2-methyl-6-chloranilin gemäss Anspruch 1.
14. Die Verbindung N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-butyryl-2-methyl-6-chloranilin gemäss Anspruch 1.
15. Die Verbindung N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-(3''-methylbutyryl)-2,6-dimethylanilin gemäss Anspruch 1.
16. Die D-Konfigurationen der Verbindungen der Formel I gemäss Anspruch 1.
17. Verfahren zur Herstellung einer Verbindung der Formel I des Anspruchs 1, gekennzeichnet durch Acylierung einer Verbindung der Formel II



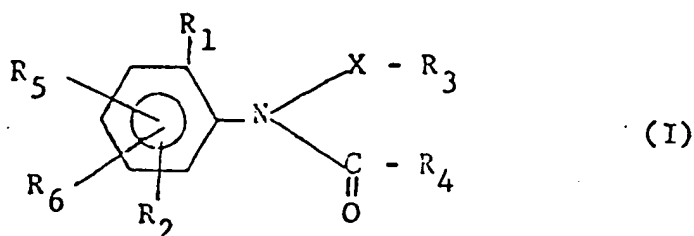
mit einer Carbonsäure der Formel III



oder ihrem Säurehalogenid, Säureanhydrid, Säureamid oder Ester.

18. Verfahren gemäss Anspruch 17, gekennzeichnet durch Acylierung mit dem entsprechenden Säurechlorid oder Säurebromid in einem Temperaturbereich von 0° bis 180° C.

19. Mikrobizides und das Pflanzenwachstum regulierendes Mittel  
enthaltend als Wirkstoff eine Verbindung der Formel I



worin

$R_1$   $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder Halogen,

$R_2$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_3$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder Halogen,

$R_5$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_3$ -Alkyl oder Halogen

$R_6$  Wasserstoff oder Methyl sind, wobei die Gesamtzahl von C-Atomen der Substituenten  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_5$  und  $R_6$  im Phenylring die Zahl 8 nicht übersteigt,

X  $-CH_2-$  oder  $\begin{array}{c} CH_3 \\ | \\ -CH- \end{array}$ ,

$R_3$   $-COOR'$  oder  $-CON \begin{array}{l} \nearrow R'' \\ \searrow R''' \end{array}$  darstellen, wobei

$R'$ ,  $R''$  und  $R'''$  unabhängig voneinander Wasserstoff, Methyl oder Aethyl bedeuten und

$R_4$  ein gegebenenfalls durch Cyano oder Rhodano substituiertes  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_5$ -Alkenyl oder  $C_3$ - $C_7$ -Cycloalkyl bedeuten, zusammen mit geeigneten Trägerstoffen und gegebenenfalls weiteren applikationsfördernden Zusätzen.

20. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend eine Verbindung der Formel I, bei der  $R_1$  Methyl bedeutet,  $R_2$  in ortho-Position zur Aminogruppe steht und Methyl, Aethyl oder Chlor bedeutet,  $-X-R_3$

die Gruppierung  $\begin{array}{c} CH_3 \\ | \\ -CH-COOR' \end{array}$  darstellt, während  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_6$  und  $R'$  die angegebene Bedeutung haben.

21. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend eine Verbindung der Formel I, bei der R' Methyl bedeutet, R<sub>4</sub> für einen Alkyl-, Alkenyl- oder Cycloalkylrest mit 2-4 C-Atomen steht und R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> die angegebene Bedeutung haben, wobei die Gesamtzahl von C-Atomen der Substituenten R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> im Phenylring die Zahl 4 nicht übersteigt.
22. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend eine Verbindung der Formel I, bei der R<sub>2</sub> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl oder Halogen und die Substituenten R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> Wasserstoff bedeuten, während die Substituenten R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, X, R', R'' und R''' die für Formel I gegebene Bedeutung haben.
23. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend eine Verbindung der Formel I, bei der R<sub>4</sub> eine Cyanomethyl- oder eine Rhodanomethyl-Gruppe bedeutet.
24. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend eine Verbindung der Formel I, bei der R<sub>1</sub> Methyl oder Aethyl bedeutet, R<sub>2</sub> in ortho-Position zur Aminogruppe steht und Methyl, Aethyl oder Chlor bedeutet, -X-R<sub>3</sub> die Gruppierung -CH<sub>2</sub>-CON(R')(R''') darstellt, während R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R'' und R''' die angegebene Bedeutung haben.
25. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend eine Verbindung der Formel I in der D-Konfiguration.
26. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-rhodanoacetyl-2,6-dimethylanilin.
27. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-cyclopropanoyl-2,6-dimethylanilin.
28. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-acryloyl-2,6-dimethylanilin.
29. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-crotonoyl-2,6-dimethylanilin.

509843/0963

30. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-crotonoyl-2-methyl-6-äthylanilin.
31. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-cyclopropanoyl-2-methyl-6-chloranilin.
32. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-crotonoyl-2-methyl-6-chloranilin.
33. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-butyryl-2-methyl-6-chloranilin.
34. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend N-(1'-Methoxycarbonyl-äthyl)-N-(3"-methyl-butyryl)-2,6-dimethylanilin.
35. Mittel gemäss Anspruch 19 enthaltend eine Verbindung der Formel I in der D-Konfiguration.
36. Verwendung einer Verbindung gemäss einem der Ansprüche 1 bis 16 zur Bekämpfung phytopathogener Pilze.
37. Verwendung einer Verbindung gemäss Anspruch 6 zur Regulierung des Pflanzenwachstums.

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**